

LIQUID COMPOSITION FOR ORAL CAVITY

Patent number: JP2000290151
Publication date: 2000-10-17
Inventor: MARUYAMA TAKASHI
Applicant: SUNSTAR INC
Classification:
- international: A61K7/16
- european:
Application number: JP19990128997 19990331
Priority number(s): JP19990128997 19990331

Report a data error here

Abstract of JP2000290151

PROBLEM TO BE SOLVED: To obtain the subject composition capable of providing a strong refreshing feeling and having an excellent feeling of use even when a small amount of menthol is formulated by including a specific tasting agent, a cold sense agent and the menthol. **SOLUTION:** This composition is obtained by including (A) one or more kinds selected from capcaisin and eugenol, (B) one or more kinds selected from menthyl lactate and ketals (e.g. 1-menthone glycerol ketal or 3,3,5-trimethylcyclohexanone glycerol ketal), isopulegol, 3-L-menthoxypropane-1,2-diol and N-substituted-p-menthane-3-carboxamides and (C) menthol. In the above composition, the respective amounts of the ingredients A and B are preferably 0.000001-0.3 wt.% and the amount of the ingredient C is preferably 0.0001-1 wt.%. The composition is especially effective in the case of a nonalcohol type composition without formulating ethanol.

Data supplied from the **esp@cenet** database - Worldwide

BEST AVAILABLE COPY

THIS PAGE BLANK (USPTO)

(19) 日本国特許庁 (J P)

(12) 公 開 特 許 公 報 (A)

(11) 特許出願公開番号
特開2000-290151
(P2000-290151A)

(43) 公開日 平成12年10月17日 (2000. 10. 17)

(51) Int.Cl.⁷
A 6 1 K 7/16

識別記号

F I
A 6 1 K 7/16

テーマコード(参考)
4 C 0 8 3

審査請求 未請求 請求項の数 2 書面 (全 5 頁)

(21) 出願番号 特願平11-128997

(22) 出願日 平成11年3月31日 (1999. 3. 31)

(71) 出願人 000106324

サンスター株式会社

大阪府高槻市朝日町3番1号

(72) 発明者 丸山 隆司

京都府長岡京市奥海印寺竹ノ下15-205

Fターム(参考) 4C083 AA122 AB052 AC102 AC111
AC112 AC122 AC211 AC212
AC302 AC341 AC342 AC432
AC471 AC482 AC622 AC641
AC642 AC692 AC782 AC862
AC902 AD042 AD531 AD532
AD662 CC41 DD23 DD27
EE06 EE31

(54) 【発明の名称】 口腔用液体組成物

(57) 【要約】

【課題】 エタノール及びメントールの配合量が極めて少ない口腔用液体組成物において、清涼性が優れ、使用感の良い口腔用組成物を提供する。

【解決手段】 エタノールをまったく含まない、もしくは配合量が1%以下である口腔用液体組成物において、特定の成分を組み合わせることにより、メントールの配合量が少ない場合でも強い清涼性が得られ、優れた使用感を有する口腔用液体組成物を得る。

【特許請求の範囲】

【請求項1】下記(a)群、(b)群から選ばれるそれぞれ1種以上、及びメントールを配合することを特徴とする口腔用液体組成物。

(a) カプサイシン、オイゲノール

(b) メンチルラクテート、ケタール類、イソプレゴール、3-レーメントキシプロパン-1, 2-ジオール、N-置換-p-メンタン-3-カルボキサミド類

【請求項2】 ノンアルコール型口腔用液体組成物であることを特徴とする請求項1記載の口腔用液体組成物。

【発明の詳細な説明】

【0001】

【発明の属する技術分野】本発明は、エタノール及びメントールの配合量が極めて少ない口腔用液体組成物において、清涼性が優れ、使用感の良い口腔用液体組成物に関する。

【0002】

【従来の技術および課題】口腔用液体組成物の使用感において、清涼性は極めて重要な香味因子であり、一般的にはペパーミントやスピアミント等のミントオイルの配合に加えて清涼成分であるメントールが別途配合されている。しかし、メントールの配合量が増すにつれてメントール自身の苦味が目立つようになり、また低温時に析出を生じやすくなるといった問題が発生することが知られている。

【0003】一方では、口腔用液体組成物には使用感の付与や低温固化の問題を回避する目的で通常エタノールが10～20重量%程度配合されているが、安全性の確保や有効成分の安定性確保といる点からエタノールを配合しないかエタノール含有量を少なくすることが望まれている。ただし、このようなノンアルコール及び低アルコールの口腔用液体組成物においては、従来のエタノール配合量を有する口腔用液体組成物に比べると油溶成分に対する可溶化力が弱く、香料の配合量が多い場合は白濁、分離、析出等が発生しやすくなるといった問題があった。このことは、清涼成分であるメントールについても同様であり、配合量を増やすアプローチに対しては、一層不利な状況になっている。

【0004】口腔用組成物の香味開発において、メントールと冷感剤を併用配合することによる清涼性の増強方法が種々検討されている。冷感剤には主としてメントール誘導体の構造をとり単一成分として清涼効果を有するものと、清涼性のない成分に対して調合技術により官能的に清涼効果をだすもの、及び両者の組合せに大別される。口腔用組成物に使用する単一成分の冷感剤としては、メンチルラクテート、ケタール類、イソプレゴール、3-レーメントキシプロパン-1, 2-ジオール、N-置換-p-メンタン-3-カルボキサミド類等がよく知られており、その多くは苦味等の嫌味を有していたり高価なものが多い。また、いずれも冷感剤自身の清涼

性はメントールと比較すると圧倒的に弱く、メントールの清涼性が存在するところで相乗的に清涼性を増強したりその質感を改善するのが実状である為、冷感剤の増量は清涼性の増強に直結していない。従って、可溶化力の弱いノンアルコールの液体製剤においてメントール自身の清涼性がほとんど期待できない香味条件下では、清涼性の増強方法に完成された技術はなく、使用感の良い口腔用液体組成物を得ることはできなかった。

【0005】

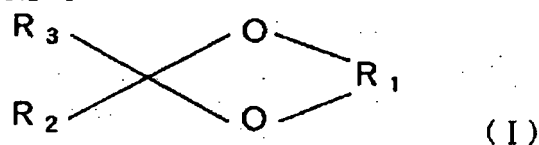
【課題を解決するための手段】本発明者らはかかる事情に鑑み鋭意検討をかさねた結果、エタノールをまったく含まないノンアルコール型、もしくは配合量が3重量%以下である低アルコール型口腔用液体組成物において、特定の呈味剤と冷感剤を組み合わせることにより、メントールの配合量が少ない場合でも強い清涼性が得られ、優れた使用感を有する口腔用液体組成物が得られることを見出し、本発明を完成するに至った。

【0006】

【発明の実施の形態】本発明に用いる(a)群はカプサイシン及びオイゲノールからなり、カプサイシンは単一成分でもカプシカムオイルや唐辛子チンキ等の天然物由来でも良い。また、オイゲノールについても単一成分でもクローブオイル、ビメントオイル、バジルオイル、カーネーションアブソリュート等の天然物由来でも良い。カプサイシン及びオイゲノールは単独でも配合可能であるが、清涼性の相乗効果の観点からは両者の併用が好ましい。これらの配合量は、特に限定するものではない、組成物全量に対して、0.000001～0.3%好ましく、0.00001～0.2重量%が特に好ましい。本発明に用いる(b)群は、メンチルラクテート、ケタール類、イソプレゴール、及び3-レーメントキシプロパン-1, 2-ジオールから選ばれる1種以上である。特にケタール類にあっては、下記一般式(I)で示されるケタール類が好ましく、特に1-メントングリセリンケタール、または3, 3, 5-トリメチルシクロヘキサノングリセリンケタールが好ましい。

【0007】

【化1】



【0008】〔但し、式中の基R₁は少なくとも1～3個のヒドロキシル基を有する炭素数2～6個のアルキレン基を表し、基R₂及びR₃は互いに独立に随時ヒドロキシル、アミノ及びハロゲンからなる群から選ばれる基を1～3個置換した炭素数1～10個のアルキル基、または炭素数5～7個のシクロアルキル、あるいは炭素数6～12個のアリールを表すが、基R₂及びR₃の全炭

素数は3以上であるか、あるいは基 R_2 及び R_3 は一緒になって基 R_2 及び R_3 の炭素原子と共に5〜7員環を構成するアルキレン基であり、このアルキレン基は炭素数1〜6個のアルキル基で置換されていることができる。]

【0009】これらの配合量は、特に限定されるものではないが、組成物全量に対して0.000001〜0.3重量%が好ましく、0.00001〜0.2重量%が特に好ましい。本発明に用いるメントールの配合量は0.0001〜1重量%であり、特に0.0005〜0.05重量%が好ましい。

【0010】本発明の効果は、エタノールを配合しないノンアルコール型口腔用液体組成物あるいはエタノールの配合量が組成物全量に対して3重量%以下の低アルコール型口腔用液体組成物の場合に特に認められ、特にノンアルコール型において有効である。

【0011】本発明の口腔用液体組成物は前記の成分に加えて、さらに組成物の形態に応じた以下のような適当な成分を本発明の効果を損なわない範囲で配合することができる。

【0012】界面活性剤として、例えば、ノニオン界面活性剤としてはポリオキシエチレンポリオキシプロピレンブロックコポリマー型ノニオン界面活性剤、ショ糖脂肪酸エステル、マルトース脂肪酸エステル、ラクトース脂肪酸エステルなどの糖脂肪酸エステル、脂肪酸アルカノールアミド類、ポリオキシエチレン硬化ヒマシ油などのポリオキシエチレン脂肪酸エステル、ソルビタン脂肪酸エステル、脂肪酸モノグリセライドなどが挙げられる。アニオン界面活性剤としては、ラウリル硫酸塩がある。両性イオン界面活性剤としては、N-ラウリルジアミノエチルグリシン、N-ミリスチルジエチルグリシンなどのN-アルキルジアミノエチルグリシン、N-アルキル-N-カルボキシメチルアンモニウムベタイン、2-アルキル-N-カルボキシメチル-N-ヒドロキシエチルイミダゾリニウムベタインがあげられる。これらの界面活性剤は、単独または2種以上を組み合わせで配合することができる。その配合量は、通常、組成物全量に対して0.01〜30重量%、好ましくは0.1〜5重量%である。

【0013】また、サッカリンナトリウム、アセスルファムカリウム、ステビオサイド、ネオヘスペリジジヒドロカルコン、グリチルリチン、ペリラルチン、タウマチン、アスパルチルフェニルアラニンメチルエステル、 ρ -メトキシシンナミックアルデヒドなどの甘味剤を、組成物全量に対して0.001〜1重量%、好ましくは0.005〜0.5重量%の割合で配合することができる。

【0014】さらに、湿潤剤として、ソルビット、グリセリン、エチレングリコール、プロピレングリコール、

1,3-ブチレングリコール、ポリエチレングリコール、ポリプロピレングリコール、キシリット、マルチット、ラクチットなどが例示され、それらを単独または2種以上を組み合わせで配合することができる。配合量は、通常、組成物全量に対して5〜30重量%である

【0015】なお、本発明の口腔用液体組成物には、薬効成分として、酢酸dl- α -トコフェロール、コハク酸トコフェロール、またはニコチン酸トコフェロールなどのビタミンE類、ドデシルジアミノエチルグリシンなどの両性殺菌剤、イソプロピルメチルフェノールなどの非イオン性殺菌剤、デキストラナーゼ、アミラーゼ、プロテアーゼ、ムタナーゼ、リゾチーム、溶菌酵素(リテックエンザイム)などの酵素、モノフルオロリン酸ナトリウム、モノフルオロリン酸カリウムなどのアルカリ金属モノフルオロフォスフェート、フッ化ナトリウム、フッ化第一錫などのフッ化物、トラネキサム酸やイブシロンアミノカプロン酸、アルミニウムクロルヒドロキシアラントイン、ジヒドロコレステロール、グリチルリチン塩類、グリチルレチン酸、グリセロフォスフェート、クロロフィル、塩化ナトリウム、カロベアタイド、水溶性無機リン酸化合物などを、単独または2種以上を組み合わせで配合することができる。

【0016】pH調整剤としては、クエン酸及びその塩、リン酸及びその塩、リンゴ酸及びその塩、グルコン酸及びその塩、マレイン酸及びその塩、アスパラギン酸及びその塩、グルコン酸及びその塩、コハク酸及びその塩、グルクロン酸及びその塩、フマル酸及びその塩、グルタミン酸及びその塩、アジピン酸及びその塩、塩酸、フッ化水素酸、水酸化アルカリ金属等を単独または2種以上を組み合わせで配合することができる。

【0017】

【実施例】以下の実施例により本発明をさらに詳細に説明する。

【0018】試験例1. 清涼性に対する官能評価

0.03%メントール単独配合の洗口剤を対照として、表1及び表2に基づき調製した試験液について、使用感を専門評価パネル(5名)により5段階実使用評価した。使用感の評価基準は下記の通りとした。

評価内容	評価基準	評価レベル
清涼性	非常に弱い	××
	やや弱い	×
	どちらとも言えない	△
	やや強い	○
	非常に強い	◎

【0019】

【表1】

	対照例	実施例 1	実施例 2	実施例 3	実施例 4
エタノール					3.0
POE 硬化ヒマシ油	0.8	0.8	0.8	0.8	0.8
ラウリル硫酸ナトリウム	0.1	0.1	0.1	0.1	0.1
グリセリン	15.0	15.0	15.0	15.0	15.0
サッカリンナトリウム	0.01	0.01	0.01	0.01	0.01
水	残	残	残	残	残
メントール	0.03	0.03	0.03	0.03	0.03
カプサイシン		0.005	0.003	0.005	0.01
オイゲノール		0.01	0.01	0.04	0.05
メンチルラクテート					0.01
イソブレゴール			0.02	0.01	
3-エーメントキシプロパン-1, 2-ジオール		0.001		0.001	
3, 3, 5-トリメチルシクロヘキサノングリセリンエタノール			0.005		0.005
使用感/清涼性の強さ	××	◎	◎	◎	◎

【0020】

【表2】

	比較例 1	比較例 2	比較例 3
エタノール		1.0	3.0
POE 硬化ヒマシ油	0.8	0.8	0.8
ラウリル硫酸ナトリウム	0.1	0.1	0.1
グリセリン	15.0	15.0	15.0
サッカリンナトリウム	0.01	0.01	0.01
水	残	残	残
メントール	0.03	0.03	0.1
カプサイシン			
オイゲノール			
メンチルラクテート	0.005		
イソブレゴール	0.005	0.005	
3-エーメントキシプロパン-1, 2-ジオール			
3, 3, 5-トリメチルシクロヘキサノングリセリンエタノール		0.001	
使用感/清涼性の強さ	××	××	△

【0021】表1及び表2の結果に示す通り、実施例（洗口液）及び比較例を調製し、評価した。メントール及びエタノールの配合量が極めて少ない口腔用液体組成物に特定の（a）群及び（b）群から選ばれる成分をを配合することにより、清涼性が飛躍的に強まり、使用感が極めて良いことが明らかとなった。以下に実施例を示すが、本発明はこれらの試験実施例に限定されるものではない。実施例中、％は特に断らない限り重量％である。

【0022】実施例5

以下の処方により、常法に従い、洗口剤を製造した。

成分名	配合量（％）
グリセリン	15.0
ポリオキシエチレン硬化ヒマシ油（60）	0.5
ラウリル硫酸ナトリウム	0.1
サッカリンナトリウム	0.02
クエン酸ナトリウム	0.05
無水クエン酸ナトリウム	0.02
メントール	0.05
カプサイシン	0.0001
オイゲノール	0.01
メンチルラクテート	0.01
香料	0.02
精製水	残部
全量	100.0

【0023】実施例6

成分名	配合量（％）
エタノール	1.0

以下の処方により、常法に従い、洗口剤を製造した。

グリセリン	15.0
ポリオキシエチレン硬化ヒマシ油(60)	0.5
ラウリル硫酸ナトリウム	0.2
メントール	0.03
カプシカムオイル	0.001
クローブオイル	0.005
3-レーメントキシプロパン-1,2-ジオール	0.001
香料	0.03
サッカリンナトリウム	0.1
塩化セチルピリジニウム	0.05
クエン酸ナトリウム	0.05
無水クエン酸ナトリウム	0.02
酢酸トコフェロール	0.02
精製水	残部
全量	100.0

【0024】実施例7

以下の処方により、常法に従い、洗口剤を製造した。

成分名	配合量(%)
グリセリン	10.0
ポリオキシエチレン硬化ヒマシ油(40)	0.8
ラウリル硫酸ナトリウム	0.4
ポリオキシエチレン(6)トリデシルエーテルリン酸	1.0
ジプロピレングリコール	10.0
パラオキシ安息香酸メチルエステル	0.005
パラオキシ安息香酸ブチルエステル	0.005
メントール	0.04
カプサイシン	0.0002
ピメントオイル	0.002
3,5-トリメチルシクロヘキサノングリセリンケタール	0.01
カプサイシン	0.0001
香料	0.05
サッカリンナトリウム	0.02
トラネキサム酸	0.03
クエン酸ナトリウム	0.05
無水クエン酸ナトリウム	0.02
精製水	残部
全量	100.0

【0025】得られた口腔用液体組成物については、上記の官能評価法で評価したところ、清涼性が強く、使用感が優れるという結果が得られた。

【0026】

【発明の効果】本発明によれば、0.05重量%以下の

メントール、特定の成分を配合することによって、エタノールをまったく配合しない、あるいは配合量が極めて少ない口腔用液体組成物において、清涼性が向上し、優れた使用感示す口腔用液体組成物が提供される。

THIS PAGE BLANK (USPTO)

**This Page is Inserted by IFW Indexing and Scanning
Operations and is not part of the Official Record**

BEST AVAILABLE IMAGES

Defective images within this document are accurate representations of the original documents submitted by the applicant.

Defects in the images include but are not limited to the items checked:

- ☐ BLACK BORDERS
- ☐ IMAGE CUT OFF AT TOP, BOTTOM OR SIDES
- ☒ FADED TEXT OR DRAWING
- ☒ BLURRED OR ILLEGIBLE TEXT OR DRAWING
- ☐ SKEWED/SLANTED IMAGES
- ☐ COLOR OR BLACK AND WHITE PHOTOGRAPHS
- ☐ GRAY SCALE DOCUMENTS
- ☒ LINES OR MARKS ON ORIGINAL DOCUMENT
- ☒ REFERENCE(S) OR EXHIBIT(S) SUBMITTED ARE POOR QUALITY
- ☐ OTHER: _____

IMAGES ARE BEST AVAILABLE COPY.

As rescanning these documents will not correct the image problems checked, please do not report these problems to the IFW Image Problem Mailbox.

THIS PAGE BLANK (USPTO)